

⑫ 公開特許公報(A)

昭61-218510

⑤ Int.Cl.⁴

A 61 K 7/06

識別記号

庁内整理番号

7417-4C

④ 公開 昭和61年(1986)9月29日

審査請求 未請求 発明の数 1 (全2頁)

⑥ 発明の名称 毛髪用剤

⑦ 特 願 昭60-58094

⑧ 出 願 昭60(1985)3月22日

⑨ 発 明 者 勝 健 一 浦和市岸町2丁目17番9号

⑩ 発 明 者 福 井 正 紀 東京都中央区日本橋3丁目14番10号 第一製薬株式会社内

⑪ 出 願 人 第一製薬株式会社 東京都中央区日本橋3丁目14番10号

明 細 書

1. 発明の名称

毛髪用剤

2. 特許請求の範囲

プロスタグランジン E₁及び／又はプロスタグランジン I₂を含有する毛髪用剤

3. 発明の詳細な説明

本発明は毛髪用剤、更に詳しくはプロスタグランジン(以下PGと称す)のうち、特にPG E₁及び／又はPG I₂を含有する発毛促進作用を有する発毛促進剤に関する。

PGは生体内に微量存在し、多彩な生理活性を有する物質として知られており、このものは更に多種類に細分化される。現在臨床の場ではPG F_{2α}、PG E₂が妊娠末期の陣痛誘発に、PG E₁が慢性動脈閉塞症に使用されており、安全性の高い(PG E₁のLD₅₀ 21 mg/kg:マウス)化合物であり、他のPG類についても臨床応用への研究が進められている。

本発明者等はPGにつき鋭意検討を進めた結果、

PGのうち特にPG E₁及びPG I₂の単独又は混合物(以下本発明対象化合物と称す)が優れた発毛促進効果を有することを見出し本発明を完成した。

即ち、本発明対象化合物を適当な外用剤とした後臨床的に脱毛症患者に塗布し発毛効果を調べた結果優れた効果が確認された。

本発明の発毛促進剤を製するには、本発明対象化合物を0.5~10 μg/ml、好ましくは1~3 μg/mlの濃度となる外用剤とすればよい。剤型としては、通常の外用投与剤型であればいずれでもよいが、経皮吸収という観点よりアルコールローション(80~90%エタノール溶液)、水溶液又は $\frac{0}{w}$ 型クリーム剤等が使用しうるが、特にpH 5~7に調整したアルコールローションとするのが主成分の安定性の点から望ましい。

かくして製した発毛促進剤は1日数回患部に塗布することにより発毛促進効果を認めることができる。

以下実施例にて本発明を説明する。

実施例 1

PG E₁ 200 μg をエチルアルコール 60 ml と精製水 40 ml に溶解しアルコールローションを製した。

実施例 2

PG E ₁	300 μg
ステアリン酸	10 g
ステアリルアルコール	5 g
モノステアリン酸グリセリン	2 g
ブチレングリコール	15 g
水酸化カリウム	0.5 g
精製水	67.5 g

上記処方方で $\frac{1}{4}$ 型クリームを製した。

実施例 3

52才男性(壮年型脱毛症)の患部に2 μg/ml の濃度のPG E₁を生理食塩水に溶解した液を1日2回各0.5 ml程度外用塗布した。2ヶ月後生毛発生、3ヶ月後硬毛化が認められた。

実施例 4

45才男性(円型脱毛症)の患部に2 μg/mlの

濃度のPG E₁を50%エタノール液に溶解した液を1日2回各0.5 ml程度外用塗布した。1~2週で脱毛が減少、1ヶ月後生毛発生、2ヶ月後硬毛化、3ヶ月後完全に回復した。

実施例 4

37才男性(円型脱毛症)の患部に1 μg/ml の濃度のPG I₂を50%エタノール液に溶解し、1日3回各0.5 mlずつ外用塗布した。約1ヶ月後に生毛、2ヶ月後に硬毛化し、4ヶ月後に完全に回復した。

実施例 5

51才男性(壮年性脱毛症)の患部に2 μg/ml の濃度のPG I₂を50%エタノール液に溶解し、1日3回0.5 mlずつを外用塗布した。約2ヶ月後に生毛の発生がみられ、4ヶ月後に硬毛化がみられた。

Japanese patent publication Serial No. 61-218510(A)

Title: Hair growth agent.

Filed: March 22, 1985

Published: September 29, 1986

Inventor: Katsu, Kenichi

Assignee: Daiichi Seiyaku (Pharmaceutical) Co.

Scope of Claim: A hair growth agent including prostaglandin E₁ and/or prostaglandin I₂.

Description: The invention relates to a hair growth agent and, more specifically, to a hair growth accelerating agent comprising prostaglandin (hereinafter PG), in particular, PGE₁ and/or PGI₁.

PG exists in the body in small amounts, is known as an agent to accelerate various physiological activities, and can be classified into many types. Currently in clinical settings, PGF_{2G} and PGE₂ are used to induce labor at the final stage of pregnancy, and PGE₁ is used to treat chronic artery obstruction. PG is considered a highly safe compound (LD₅₀ of PGE₁ is 21 mg/kg: mouse), and research is under way to explore clinical applications of other types of PG.

The applicants of the present invention have extensively investigated PG, and found that PGE₁ and/or PGI₁, individually or in mixture (hereinafter "the inventive compound") exhibit a superb hair growth acceleration effect.

Specifically, when the inventive compound was processed into the form of external medication and applied on a bald patient, good hair growth effects were observed.

To produce the hair growth accelerating agent of the present invention, the inventive compound should be included in the external medication with a preferable density of 0.5-10 mg/ml, further preferably with a density of 1-3 mg/ml. Any conventional external medication forms may be used, but to enhance endermic absorption, alcohol lotion (30-90% ethanol solution), aqueous solution, or o/w-type cream may be used. To stabilize the main components of the compound, it is preferable to use alcohol lotion having 5-7 pH.

Thus obtained hair growth accelerating agent may be applied once a day on a patient, to exhibit some hair growth effect.

Example 1:

200 mg of PGE₁ was dissolved in 60 ml of ethyl alcohol and 40 ml of refined water to form alcohol lotion.

Example 2:

PGE ₁	300 mg
Stearin acid	10 g
Stearyl alcohol	5 g
Glycerin monostearate	2 g
Butylen glycol	15 g
Potassium hydroxide	0.5g
Refined water	67.5 g

The above composition was used to form an o/w-type cream.

Example 3:

A 52-year-old male, having baldness due to aging, received PGE₁ dissolved in physiological saline with 2 mg/ml density, in the amount of 0.5 ml each for twice a day. After 2 months hair growth was observed. After 3 months hair started to harden.

Example 4:

A 45-year-old male, having a circular bald spot, received PGE₁ dissolved in 50% ethanol solution with 2 mg/ml density, in the amount of 0.5 ml each for twice a day. After 1 to 2 weeks hair loss started to slow, after 1 month hair started to grow, after 2 months hair started to harden, and after 3 months hair was fully restored.

Example 5:

A 37-year-old male, having a circular bald spot, received PGI₂ dissolved in 50% ethanol solution with 1 mg/ml density, in the amount of 0.5 ml each for twice a day. After about 1 month hair started to grow, after 2 months hair started to harden, and after 4 months hair was fully restored.

Example 6:

A 51-year-old male, having baldness due to aging, received PGI₂ dissolved in 50% ethanol solution with 2 mg/ml density, in the amount of 0.5 ml each for three times a day. After about 2 months hair started to grow, and after 4 months hair started to harden.